

# BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND



## Prioritätsbescheinigung über die Einreichung einer Patentanmeldung

**Aktenzeichen:** 102 53 042.4

**Anmeldetag:** 14. November 2002

**Anmelder/Inhaber:** Wacker-Chemie GmbH,  
München/DE

**Bezeichnung:** Kosmetische Zubereitung enthaltend einen  
Komplex aus Cyclodextrin und Vitamin F

**IPC:** A 61 K 7/00

Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlagen dieser Patentanmeldung.

München, den 31. Juli 2003  
Deutsches Patent- und Markenamt  
Der Präsident  
Im Auftrag



Siegel

## Kosmetische Zubereitung enthaltend einen Komplex aus Cyclodextrin und Vitamin F

Die Erfindung betrifft eine kosmetische Zubereitung enthaltend  
5 einen Komplex aus Cyclodextrin und Vitamin F sowie bevorzugte Komplexe aus Cyclodextrinen und Vitamin F.

Cyclodextrine sind cyclische Oligosaccharide, die aus 6,7 oder  
8  $\alpha(1-4)$ -verknüpften Anhydroglukoseeinheiten aufgebaut sind.

10 Die durch enzymatische Stärkekonversion hergestellten  $\alpha$ -,  $\beta$ - oder  $\gamma$ -Cyclodextrine unterscheiden sich in dem Durchmesser ihrer hydrophoben Kavität und eignen sich generell zum Einschluss zahlreicher lipophiler Substanzen.

15 Vitamin F, besteht im wesentlichen aus einer Mischung aus essentiellen Fettsäuren (Essential Fatty Acids - EFA), insbesondere Omega-6-polyungesättigten Fettsäuren. Daher wird im Sinne der vorliegenden Erfindung unter Vitamin F vorzugsweise EFA insbesondere Omega-6-polyungesättigte Fettsäure verstanden.

20 EFA kann der Körper nicht selbst in der benötigten Menge herstellen, eine ausreichende Versorgung ist jedoch für natürliche Funktionen des Körpers essentiell. Der in vorliegender Anmeldung verwendete Ausdruck „essentielle Fettsäuren“ umfasst vorzugsweise ungesättigte Fettsäuren mit Kettenlängen größer bzw. gleich 18 Kohlenstoffatomen, die mindestens zwei Doppelbindungen aufweisen. Bei den Omega-6-polyungesättigten Fettsäuren handelt es sich besonders bevorzugt um Linolsäure und ihre Isomere, um Linolensäure und ihre Isomeren sowie anderen sehr oxidationsempfindliche Säuren. Vitamin F entfaltet, wie  
30 sich gezeigt hat, bestimmte Eigenschaften, die u.a. zur Verbesserung des Aussehens der Haut besonders erwünscht sind.

Bei Untersuchungen konnte insbesondere gezeigt werden, dass Kombinationen aus mindestens einer essentiellen Fettsäure oder  
35 Mischungen davon und insbesondere von Vitamin F eine bemerkenswerte Oxidationsbeständigkeit aufweisen, die sich dann nicht zeigt, wenn man essentiellen Fettsäuren und insbesondere

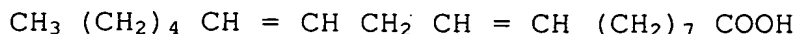
Vitamin F nicht in Form der erfindungsgemäßen Wirkstoffkombination verwendet.

Die topische Anwendung von Vitaminen in der Kosmetik wurde bereits von einer Reihe von Autoren vorgeschlagen. Als besonders empfohlene Vitamine kann man nennen Vitamin A, Vitamin B, die Vitamine B<sub>2</sub>, und B<sub>6</sub>, Vitamin E, Vitamin H bzw. deren Cyclo-dextrinkomplexe sowie bestimmte geeignete Vitaminmischungen wie eine Mischung aus Vitamin A, Vitamin E und Vitamin D<sub>3</sub>, welche Kombination einen synergistischen Effekt aufweist.

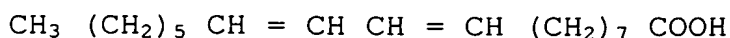
Das Vitamin, das das besondere Interesse der Formulierer von Kosmetikprodukten gefunden hat, ist das Vitamin F. Es übt eine günstige Wirkung auf trockene und raue Haut sowie auf die Haut aus, die bestimmte Reizanzeichen zeigt. Die Anwendung des Vitamins F in der Kosmetik wurde stets von dem besonders akuten Problem beeinträchtigt, das im wesentlichen in der großen Instabilität dieses Materials gegen die Oxidation durch den Sauerstoff der Atmosphäre zu sehen ist. Es hat sich insbesondere gezeigt, dass sich sehr schnell nach Lagerung bzw. der ersten Benutzung Zersetzungsprodukte mit ranzigem Geruch bilden, die die weitere Anwendung von kosmetischen Präparaten auf der Grundlage dieses Vitamins verhindern. Da das Vitamin F im wesentlichen aus Linolsäure, Linolsäure und ihren Isomeren und insbesondere aus Linolensäure und ihren Isomeren und andere sehr oxidationsempfindlichen Säuren besteht, hat man vorzugsweise in der Kosmetik sowie in Lebensmittel die entsprechenden Alkohole oder die Ester z.B. die Triglyceride dieser Säure verwendet, die stabiler sind, wobei in diesem Fall ein erheblicher Aktivitätsverlust hingenommen werden muss. Möglichkeiten zur Stabilisierung der essentiellen Fettsäuren sind somit von außerordentlichem Interesse.

Der in vorliegender Anmeldung verwendete Ausdruck „essentielle Fettsäuren“ umfasst besonders bevorzugt ungesättigte Fettsäuren, die mindestens zwei Doppelbindungen aufweisen, wie:

Linolsäure oder 9,12-Octadecadiensäure der Formel



und deren Stereoisomere insbesondere das z-9, z-12-Isomere sowie deren Stellungsisomere oder konjugierte Linolsäuren, d.h.: 9,11-Octadecadiensäure der Formel



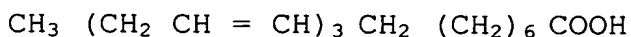
und deren Stereoisomere

10,12 Octadecadiensäure der Formel



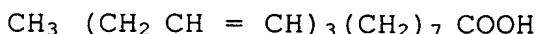
und deren Stereoisomere;

$\alpha$ -Linolensäure oder 9,12,15- Octadecatriensäure der Formel



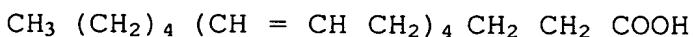
und deren Stereoisomere und insbesondere das z-9, z-12, z-15-Isomer;

$\gamma$  Linolensäure oder 6,9,12- Octadecatriensäure der Formel



und deren Stereoisomere; und

Arachidonsäure oder 5,8,11,14-Eicosatetraensäure der Formel



Wichtige physiologische Funktionen von Vitamin F u.a. wegen des hohen Anteils von Linolsäure, sind der Aufbau der Arachidonsäure, einem Bestandteil von Phospholipiden (Zellmembrane) u. Prostaglandinen (Autocoide), die Einfluss auf den Serumcholesterin-Spiegel und den Blutdruck nehmen. Ein Mangel an Linolsäure führt bei Kindern zu Wachstumsstörungen, erhöhter Infektanfälligkeit, Hautveränderungen (Ekzemen) und zu einer gestörten Funktion der Kapillaren. Vitamin F wird bei Wundheilungsstörungen eingesetzt. Die bereits in geringer Konzentration festzustellenden hautpflegenden Eigenschaften machen es zu einer äußerst wertvollen Substanz. Im Bereich der Kosmetik besteht daher ein großes Interesse am verstärkten Einsatz von Vitamin F besonders in dermatologischen Formulierungen. Die topische Applikation von Vitamin F stabilisiert den Haushalt der Haut an essentiellen Fettsäuren. Eine Unterversorgung mit Vitamin F führt zu einer Schädigung speziell der Zellmembrane der Haut (Phospholipidstruktur) als auch in den Hautlipiden

(Ceramid Struktur) zu verstärkter Falten- und Hornbildung ("Photoaging") und zu einem Elastizitätsverlust der Haut. Die Hautlipide mit einem hohen Anteil an mehrfach ungesättigten Fettsäuren, wie der Linolsäure, zeigen eine höhere Packungsdichte, welche offenbar die Barrierefunktion gegenüber Mikroorganismen stärkt sowie einen verminderten trans-epidermalen Wasserverlust. Dies konnte an Versuchen auf menschlicher wie tierischer Haut bei topischer Anwendung bewiesen werden. Zudem werden aus der Linolsäure Hautlipide synthetisiert.

Das Hauptproblem für die breitere Anwendung von Vitamin F besteht in seiner Empfindlichkeit gegen Oxidation, insbesondere unter Lichteinwirkung.

An der konjugiert ungesättigten Kohlenwasserstoffkette des Fettsäuremoleküls findet eine Autoxidation statt, die zur Bildung zahlreicher Zersetzungsprodukte, zu Isomerisierungen und Polymerisationen führt. Beim Ranzigwerden von Fetten kann beispielsweise die Linolsäure, eine der essentiellen Fettsäuren in eine isomere Fettsäure mit konjugierter Doppelbindung übergehen, die keinen Vitamin-Charakter mehr besitzt u. Mangelschäden sogar verstärken kann. Aus der ursprünglich öligen, dünnflüssigen Substanz entsteht dabei eine zäh-flüssige Masse. Der Geruch wird als intensiv ranzig wahrgenommen. Durch intermediär gebildete Peroxide erhöht sich das toxische Potential der Formulierungen, der kosmetisch wie ernährungsphysiologisch erwünschte Effekte des intakten Vitamin F wird verringert.

Wie bereits angegeben, besteht Vitamin F im wesentlichen aus Linolsäure und deren Isomeren, wobei insbesondere bevorzugt das 9,12-Isomere in einer Menge enthalten ist, die zwischen etwa 40 und 70% liegt, wobei der Gesamtanteil der Linolsäure und deren Isomere etwa 80 bis 90% des Materials bildet, während der Rest des Materials im wesentlichen aus einer Mischung von anderen essentiellen Fettsäuren besteht.

In CH 646049 wird die Herstellung von oxidationsbeständigen kosmetischen Zubereitungen, die Vitamin F bzw. essentielle Fettsäuren enthalten mittels eines pflanzlichen Öles nämlich Jojoba-Öl beschrieben.

In Biol. Food Chem. Aspects, Contrib. Lipidforum/Sik Symp., Meeting Date 1985, 165-70 wird die Stabilisierung von Lipiden über den molekularen Einschluss von Linolsäure mit Cyclo-  
 5 dextrinen mit Casein als Antioxidant in Dispersion, beschrieben.

Aus Biochem. J. (1995) 308, 151-154 (Print in Great Britain) ist der Einsatz von „löslichen Lipiden“ für biochemische Prozesse mittels Linolsäure-CD-Komplexe in wässriger Lösung, be-  
 10 kannt

In der japanischen Patentschrift 60181014A ist die Herstellung von Badeprodukt -Zusätzen mit Vitaminen u.a. Vitamin F  
 15 mittels Cyclodextrinen u. Diastase beschrieben.

Eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung ist es, eine kosmetische oder dermatologische Zubereitungen enthaltend Vitamin F, zur Verfügung zu stellen, die gegenüber oxidativer Zersetzung  
 20 stabilisiert ist.

Die Aufgabe wird gelöst durch eine Zubereitung die dadurch gekennzeichnet ist, dass das Vitamin F in Form eines Komplexes mit einem Cyclodextrin ausgewählt aus der Gruppe alpha, beta- und gamma- Cyclodextrin vorliegt.  
 25

Die erfindungsgemäße kosmetische oder dermatologischen Zubereitungen ist oxidationsbeständig und eignet sich bevorzugt zur Pflege und zum Schutz der Haut, insbesondere der empfindlichen und der trockenen Haut. Insbesondere behebt sie die mit einer Hautalterung verbundenen Schäden und dient der Prophylaxe dauerhaft und ohne Risiko von Nebenwirkungen, indem sie die Nachteile des Standes der Technik vermeiden.  
 30

Der Komplex aus Vitamin F und Cyclodextrin (CD) kann dabei in an sich bekannter Weise aus z.B. Lösung oder mit Pastenmethode hergestellt werden. Als vorteilhaft hat sich die Herstellung aus konzentrierten, wässrigen CD-Lösungen erwiesen. Die CD-  
 35

Konzentration der wässrigen Lösungen liegt vorzugsweise zwischen 5-50 Gewichts-%, bevorzugt ist eine CD-Konzentration von 20-50%.

- 5 Das Gewichts-Verhältnis von Vit- F zu CD liegt zwischen 1 : 4 und 1 : 40, bevorzugt zwischen 1: 15 und 1 : 20. Die Ansätze werden je nach Konsistenz intensiv gerührt oder geknetet.

10 Die Reaktionstemperatur liegt üblicherweise bei 20 - 85°C. Bevorzugt wird bei 20 - 75 °C, besonders bevorzugt bei 50 - 70 °C gearbeitet. Die Reaktionsdauer hängt von der Temperatur ab und liegt vorzugsweise zwischen einer Stunde und einigen Tagen. Bevorzugt ist eine Reaktionszeit von 30 bis 80 Stunden.

- 15 Die Komplexierung erfolgt in der Regel unter Normaldruck. Bevorzugt findet die Komplexierung unter Schutzgasatmosphäre (Stickstoff oder Argon) statt.

20 Die wenig wasserlöslichen Komplexe aus Vit. F und CD können direkt verwendet werden. Sie können aber auch durch Filtration, Zentrifugation, Trocknung, Mahlen, Sieben, Sichten, Granulieren, Tablettieren entsprechend isoliert und aufbereitet werden. Insbesondere vorteilhaft sind Komplexe aus Cyclo-  
 25 dextrin und mindestens einer Fettsäure von Vit. F bzw. essentieller Fettsäure welche die folgenden molaren Verhältnisse aufweisen:

1mol alpha-Cyclodextrin : 1mol einer essentiellen Fettsäure  
 2mol alpha-Cyclodextrin : 1mol einer essentiellen Fettsäure  
 30 3mol alpha-Cyclodextrin : 1mol einer essentiellen Fettsäure  
 4mol alpha-Cyclodextrin : 1mol einer essentiellen Fettsäure

1mol beta-Cyclodextrin : 1mol einer essentiellen Fettsäure  
 2mol beta-Cyclodextrin : 1mol einer essentiellen Fettsäure  
 35 3mol beta-Cyclodextrin : 1mol einer essentiellen Fettsäure

1mol gamma-Cyclodextrin : 1mol einer essentiellen Fettsäure  
 2mol gamma-Cyclodextrin : 1mol einer essentiellen Fettsäure

3mol gamma-Cyclodextrin : 1mol einer essentiellen Fettsäure  
sowie eine Mischung dieser Komplexe.

- 5 Besonders bevorzugt sind Komplexe aus alpha, beta oder gamma-Cyclodextrin und einer essentiellen Fettsäure im Verhältnis 3 : 1 oder 4 : 1 sowie eine Mischung enthaltend diese Komplexe.

10 Es zeigte sich bei den Untersuchungen zu vorliegender Anmeldung, dass insbesondere diese Komplex Vit. F in besonders hohem Maße stabilisieren..(Fig. 1)

Die Erfindung betrifft daher auch Komplexe aus Cyclodextrin und einer essentiellen Fettsäure im Verhältnis 3 : 1 oder 4 :  
15 1 sowie eine Mischung enthaltend diese Komplexe. Besonders bevorzugt handelt es sich bei dem Cyclodextrin um alpha-Cyclodextrin.

Bevorzugt enthält die Mischung 4:1 Komplexe von alpha CD und  
20 essentieller Fettsäure in einer Menge von 10 bis 90 Gew. %,  
3:1 Komplexe von alpha CD und essentieller Fettsäure in einer Menge von 40 bis 80 Gew. %,   
2:1 Komplexe von alpha CD und essentieller Fettsäure in einer Menge von 30 bis 70 Gew. %,   
25 1:1 Komplexe von alpha CD und essentieller Fettsäure in einer Menge von 20 bis 60 Gew. %.

Die kosmetischen und dermatologische Formulierungen, die Wirkstoffkombination von Cyclodextrin mit Vit. F, vorzugsweise einer  
30 essentiellen Fettsäure, enthalten, liegen in verschiedenen Formen vor z.B. als Emulsionen vom Typ Wasser-in-Öl (W/O) oder Öl-in-Wasser (O/W), Zubereitungen dieser Art sind Milchpräparate, Lotionen, Cremes oder Salben sowie Gels, Puder, Masken, Packungen, Sprays, Aerosole oder Stifte die entweder  
35 zum Färben der Lippen oder zur Behandlung von aufgesprungenen Lippen dienen, oder Schminkprodukten für die Augen oder der Gesichtsschminke.



Erfindungsgemäße kosmetische und dermatologische Formulierungen enthalten vorzugsweise auch lineare wie cyclische Silikonöle z.B. Dimethicone sowie Cyclomethicone

feuchthaltende Mittel, also Substanzen, welche die Haut vor dem Austrocknen schützen, wie Propylenglycol, Mg-Sulfat, Glycerin,

Substanzen, welche die Haut pflegen, wie Cetyl Alkohol, Paraffinum liquide, Petrolatum, Caprylic/Capric Triglyceride, Mineralöle, Stearinsäure, Bienen-, Candillawachs, Isopropyl- und Myristyl Myristate, Octyldodecanol, Octyldodecylolate, Polyethylenglycol (PEG)-22/Dodecyl Glycol Copolymer, Hydrolysiertes Weizenkeimprotein, natürliche Öle z.B. Sonnenblumen-, Soja-, Mandel-, Palm-, Kokos- und Olivenöl

Gel-Bildner, wie Salze des Carbopols, Polymethacrylate, Polysacharide

O/W sowie W/O-Emulgatoren, z. B.: Polysorbate 20, PEG-40 Stearate, PEG Hydrogenated Castor Oil, Aluminium-, Octyl- oder Glyceryl Stearate, Lecithin,

Konservierungsmittel wie Urea, Chlorhexidine Digluconate, Phenoxyethanol, Natriumbenzoat, Sorbinsäure, Methyl-, Ethyl-, Butylparabene, BHT, BHA,

Bakterizide, Antioxidantien wie Vitamin C und entsprechende Derivate, alpha-Hydroxysäuren und entsprechende Derivate, Vitamin E und entsprechende Derivate, Sonnenschutzfilter wie

UVA- und UVB-Filter, z.B. Oxyde 4-Methylbenzylidene Camphor, DEA-methoxycinnamate, Benzophenone-4, Octyldimethyl PABA, anorganische Pigmente wie Oxyde von Titanium, Eisen, Zink,

Selbstbräunungsmittel wie: Dihydroxyacetone, Zusatzstoffe- und Hilfsstoffe beispielsweise Insektrepellentien, Konsistenzgeber,

Füllstoffe, Elektrolyte, Vitamine, Alkohol, Wasser, Salze, Stabilisatoren, Farbstoffe, Parfüme, etherische Öle.

Eine erfindungsgemäße Zusammensetzung wird durch Einarbeitung eines CD/Vitamin F Komplexes in eine übliche kosmetische oder dermatologische Formulierung hergestellt. Vorzugsweise erfolgt die Herstellung durch Dispergieren des Komplexes in Wasser sowie einmischen der wässrigen Dispersion in den lipophilen Teil der Emulsion. Dieser Verfahrensschritt ist essentiell für die

kosmetische Qualität der Emulsion. Hautpflegeprodukte zeichnen sich beim Auftragen auf die Haut durch ein angenehmes Hautgefühl aus. Setzt man die Komplexe ohne vorherige Dispergierung in kosmetische Emulsionen ein, ergibt sich beim Auftragen ein sandiges bis kratziges Hautgefühl. Wird der Komplex nicht in der beschriebenen Weise durch Dispergieren zu Teilchengrößen < 200 Micrometer aufbereitet ist ein zusätzlicher Arbeitsschritt wie mahlen bzw. sieben zwingend. Durch die Dispergierung können Komplexe beliebiger Teilchengröße, also auch Granulate, ohne zusätzliche Zerkleinerung großer Komplexeilchen in kosmetische Formulierungen wie Emulsionen eingesetzt werden. Die Dispergierung kann über einen Zeitraum von 10 Minuten bis 2 Stunden bei Temperatur von 20°C bis 80°C, bevorzugt 30 Minuten bei 30-50°C erfolgen.

Die folgenden Beispiele dienen der weiteren Erläuterung der Erfindung.

**Beispiel 1: Komplexierung von Linolsäure mit  $\alpha$ -Cyclodextrin**

- a.) 0,1 mol  $\alpha$ -Cyclodextrin wurden mit 100g H<sub>2</sub>O versetzt, 0,1mol Linoläure zugegeben, homogenisiert und 30h bei RT sowie 8h bei 70°C gerührt. Die Wirkstoffkombination wird in Wasser dispergiert, filtriert, mit Wasser gewaschen und bei 40°C unter Vakuum getrocknet.
- b.) 0,1 mol  $\alpha$ -Cyclodextrin wurden mit 100g H<sub>2</sub>O versetzt, 0,05mol Linoläure zugegeben, homogenisiert und 30h bei RT sowie 8h bei 70°C gerührt. Die Wirkstoffkombination wird in Wasser dispergiert, filtriert, mit Wasser gewaschen und bei 40°C unter Vakuum getrocknet.
- c.) 0,1 mol  $\alpha$ -Cyclodextrin wurden mit 100g H<sub>2</sub>O versetzt, 0,033mol Linoläure zugegeben, homogenisiert und 70h bei RT sowie 8h bei 70°C gerührt. Die Wirkstoffkombination wird in Wasser dispergiert, filtriert, mit Wasser gewaschen und bei 40°C unter Vakuum getrocknet.
- d.) 0,1 mol  $\alpha$ -Cyclodextrin wurden mit 100g H<sub>2</sub>O versetzt, 0,025mol Linoläure zugegeben, homogenisiert und 70h bei RT sowie 8h bei 70°C gerührt. Die Wirkstoffkombination

wird in Wasser dispergiert, filtriert, mit Wasser gewaschen und bei 40°C unter Vakuum getrocknet.

**Beispiel 2 Herstellung der physikalischen Mischung  $\alpha$ -Cyclodextrin/Linolsäure 4:1 (Vergleichsbeispiel)**

$\alpha$ -Cyclodextrin 0,01mol wurden in eine Reibschale eingewogen und mit 0,0025mol Linolsäure intensiv verrieben, bis ein homogenes Pulver erhalten wurde.

**Beispiel 3 Bestimmung der Lagerstabilität von Komplexen aus  $\alpha$ -Cyclodextrinen und Linolsäure sowie als physikalische Mischung, entsprechend einem 4:1- Komplex von  $\alpha$ -Cyclodextrin mit Linolsäure**

bei 45°C gelagert

Komplex aus  $\alpha$ -Cyclodextrinen und Linolsäure 1:1

Komplex aus  $\alpha$ -Cyclodextrinen und Linolsäure 2:1

Komplex aus  $\alpha$ -Cyclodextrinen und Linolsäure 3:1

Komplex aus  $\alpha$ -Cyclodextrinen und Linolsäure 4:1

Mischung der Wirkstoffkombination aus  $\alpha$ -Cyclodextrinen und Linolsäure der molaren Verhältnisse von 1:1, 2:1, 3:1 und 4:1

Physikalische Mischung von  $\alpha$ -Cyclodextrin 4:1 Linolsäure

Alle Ansätze werden in offenen Schalen bei 45°C im Trockenschrank gelagert.

Der Gehalt an Linolsäure der physikalischen Mischung und der Wirkstoffkombinationen wurde über NMR bestimmt.

Fig: 1 zeigt den Linolsäure-Gehalt in den gelagerten Proben in Abhängigkeit von der Lagerdauer.

**Beispiel 4: Komplexierung von Linolsäure mit  $\beta$ -CD**

0,1 mol  $\beta$ -Cyclodextrin wurden mit 100g H<sub>2</sub>O versetzt, 0,033mol Linoläure zugegeben, homogenisiert und 70h bei RT sowie 8h bei 70°C gerührt. Die Wirkstoffkombination wird in Wasser dispergiert, filtriert, mit Wasser gewaschen und bei 40°C unter Vakuum getrocknet.

**Beispiel 5: Komplexierung von Linolsäure mit  $\gamma$ -CD**

0,1 mol  $\gamma$ -Cyclodextrin wurden mit 100g H<sub>2</sub>O versetzt, 0,033mol Linoläure zugegeben, homogenisiert und 70h bei RT sowie 8h bei 70°C gerührt. Die Wirkstoffkombination wird in Wasser dispergiert, filtriert, mit Wasser gewaschen und bei 40°C unter Vakuum getrocknet.

**Beispiel 6: Herstellung kosmetischer Formulierungen mit einer Wirkstoffkombination von  $\alpha$ -Cyclodextrin mit Linolsäure.**

a) Herstellung einer Sonnenschutzcreme mit einer Wirkstoffkombination von  $\alpha$ -Cyclodextrin mit Linolsäure.

Komponenten A mischen und auf 60°C erhitzen, B zu A zugeben, homogenisieren, Komponente C 15min. bei 60°C dispergieren und in AB einmischen.

Zusammensetzung und Gewichtsanteile:

Wirkstoffe	Gewichtsanteile
<b>A</b>	
Octyl Palmitat	2,5%
Octylstearat	3,5%
Polyglycerol-2 Sesquisostearat	2,0%
Cyclomethicone, Dimethiconol	3,0%
Lauryl Dimethicon	2,0%
Octyl Dimethucone Ethoxy Glycosid, Cyclomethicon	12,0%
<b>B</b>	
Titan Dioxid	5,0%
Polymethylsilsesquioxan	1,0%
Zink Oxyde	2,0%
<b>C</b>	
Glycerin	2,0%
Methylparaben	0,1%
Natriumchlorid	0,4%
Wasser	59,0%
$\gamma$ -Cyclodextrin- $\alpha$ -Tocopherol-Komplex	1,5%
$\alpha$ -Cyclodextrin-Linolsäure Komplex	4,0%

b) Herstellung einer W/O Bodylotion mit einer Wirkstoffkombination von  $\alpha$ -Cyclodextrin mit Linolsäure

b) Herstellung einer W/O Bodylotion mit einer Wirkstoffkombination von  $\alpha$ -Cyclodextrin mit Linolsäure

- 5 Komponenten A auf 70°C erwärmen, B nach 30min. dispergieren bei Raumtemperatur auf 70°C erwärmen und in A einarbeiten, gut homogenisieren, unter Rühren auf 40°C abkühlen, C zugeben, bis Erkalten weiter rühren.

Zusammensetzung und Gewichtsanteile:

10

Wirkstoffe	Gewichtsanteile
A	
Bienenwachs	3,0%
Hostacerin	3,0%
Belsil CM 1000	5,0%
Belsil DM 1plus	7,0%
Belsil PDM 20	4,55%
Belsil SPG 128 VP	12,0%
B	
Natriumchlorid	2,0%
Wasser	59,4%
$\alpha$ -Cyclodextrin-Linolsäure Komplex	4,0%
C	
Kathon	0,05%

c) Herstellung einer After Sun Lotion mit einer Wirkstoffkombination von  $\alpha$ -Cyclodextrin mit Linolsäure

- 15 Komponenten A und B auf 75°C erwärmen. Komponente D 30min. bei Raumtemperatur dispergieren, in B einarbeiten, A unter Rühren der Mischung der Komponenten A und D zufügen. Nach 5 min. C zugeben und auf 40°C abkühlen. E zugeben und unter Rühren auf Raumtemperatur abkühlen.

## Zusammensetzung und Gewichtsanteile:

Wirkstoffe	Gewichtsanteile
A	
Cetylalkohol	1,5%
Mineralöl	5,0%
Stearinsäure	5,0%
B	
Allantoin	0,5%
Propylenglykol	3,0%
Wasser	45,0%
C	
Cyclomethicone, Dimethicone	15,0%
Phenyl Trimethicone	2,0%
D	
$\alpha$ -Cyclodextrin-Linolsäure Komplex	2,0%
$\gamma$ -Cyclodextrin-Retinol Komplex	0,4%
Wasser	20,0%
E	
Phenoxyethanol, Methylparaben, Butylparaben, Ethylparaben, Propylparaben,	0,3%
Parfüm	0,3%

d) Herstellung einer O/W Bodylotion mit einer Wirkstoffkombination von  $\alpha$ -Cyclodextrin mit Linolsäure

Komponente A 30min. bei Raumtemperatur dispergieren, auf 75°C erwärmen, B einarbeiten, C auf 70°C erwärmen und langsam in AB einrühren, dann D einrühren auf bei Raumtemperatur abkühlen.

## Zusammensetzung und Gewichtsanteile:

Wirkstoffe	Gewichtsanteile
A	
Carbopol	0,1%
Wasser	80,0%
Glycerin	3,0%
$\alpha$ -Cyclodextrin-Linolsäure Komplex	4,4%
B	
Triethanolamin	0,9%
C	
Stearinsäure	0,8%
Isopropylmyristat	3,0%
Nexbase	2,0%
Arlacel 165	1,5%
Cetylalkohol	1,0%
D	
Belsil	3,0%
BHT	0,3%

- 5 e) Herstellung einer O/W Gesichtsscreme mit einer Wirkstoffkombination von  $\alpha$ -Cyclodextrin mit Linolsäure

Komponente A + B getrennt auf ca. 65°C erwärmen. Phase B ca. 10 min. dispergieren, vorlegen und Phase A unter Rühren zugeben, homogenisieren.

- 10 Zusammensetzung und Gewichtsanteile:

Wirkstoffe	Gewichtsanteile
A	
Steryl-glucoside	3%
Glyceryl Stearate	2%
Stearyl Alkohol	1%
Decyl Coate	10%
Cetyl Ethylhexanoate	9%

B	
Glycerin	3%
Wasser	62%
$\alpha$ -Cyclodextrin- Linolsäure Komplex	9%
$\gamma$ -Cyclodextrin- Retinol Komplex	1%

f) Herstellung einer O/W Feuchtigkeitscreme mit einer Wirkstoffkombination von  $\alpha$ -Cyclodextrin mit Linolsäure

- 5 Komponente A + B getrennt auf 65°C erwärmen, Phase B ca. 10 min. dispergieren, vorlegen und Phase A unter Rühren zugeben, dann Phase C. Die erhaltene Cremeformulierung homogenisieren.

Zusammensetzung und Gewichtsanteile:

Wirkstoffe	Gewichtsanteile
A	
Steryl-glucoside	3,0%
Glyceryl Stearate	2,1%
Stearyl Alkohol	0,9%
Ethylhexyl-Stearate	10,0%
Caprylic / Capric Triglyceride	10,0%
Avocadoöl	3,7%
B	
Glycerin	3,0%
Wasser	59,0%
$\alpha$ -Cyclodextrin- Linolsäure Komplex	6,0%
C	
Sodium Lactate, Urea, Lactic Acid	2,0%
Tocopherylacetat	0,3%

g) Herstellung eines flüssig Make-up mit Wirkstoffkombination von  $\alpha$ -Cyclodextrin mit Linolsäure

- 15 A auf 75°C erwärmen, B unter Turrax in A einarbeiten, auf gute Pigmentverteilung achten, C 20 min. bei 50°C dispergieren unter Turrax in AB einemulgieren, unter Rühren auf 40°C kühlen, D einrühren, auf RT abkühlen, kalt mit Turrax homogenisieren.



## Zusammensetzung und Gewichtsanteile:

Wirkstoffe	Gewichtsanteile
A	
Weißes Bienenwachs	2,70%
Polyglyceryl-2 Sesquiisostearate	2,40%
Dimethicone	10,00%
Dimethicone	2,50%
Octyl Dimethicone Ethoxy Glucosid, Cyclomethicone	11,00%
Trimethylsiloxysilicat	1,50%
B	
Eisenoxid	1,45%
Talk	5,00%
Titan Dioxide;	7,00%
C	
Natriumchlorid	2,00%
Wasser	50,00%
$\gamma$ -Cyclodextrin- $\alpha$ -Tocopherol- Komplex	1,70%
$\alpha$ -Cyclodextrin-Linolsäure Komplex	2,40%
D	
Methylchloroisothazolinone	0,05%
Parfüm	0,30%

h) Herstellen einer Körperemulsion mit Wirkstoffkombination von  $\alpha$ -Cyclodextrin mit Linolsäure

Die Rohstoffe A werden in einem Becherglas vorgelegt auf 65°C erwärmt, die Rohstoffe B in einem Rührgefäß bei 50°C 20min. dispergiert. Beide Mischungen emulgiert man bei 65°C mit einem schnelllaufenden Flügelrührer und lässt unter weiterem Rühren auf 40°C abkühlen und homogenisiert mit dem Ultra-Turrax (max. 500 Upm). Die in der Creme gelöste Luft wird durch vorsichtiges Anlegen von Wasserstrahlvakuum entfernt.

Wirkstoffe	Gewichtsanteile
A	
Glycerinmonomyristat	1,4%
Stearinsäure	1,2%
Cetylalkohol	0,5%
Isopropylpalmitat	5,0%
B	
Wasser dest.	87,5%
Methylparaben	1,0%
$\alpha$ -Cyclodextrin-Linolsäure Komplex	3,4%

### Patentansprüche

1. Kosmetische oder dermatologische Zubereitungen enthaltend Vitamin F, dadurch gekennzeichnet, dass das Vitamin F in  
5 Form eines Komplexes mit einem Cyclodextrin ausgewählt aus der Gruppe alpha, beta- und gamma- Cyclodextrin vorliegt.
2. Zubereitungen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass Vitamin F eine essentielle Fettsäure ist.
- 10 3. Zubereitungen gemäß Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, dass essentielle Fettsäure und Cyclodextrin im Komplex in einem der folgenden Verhältnisse vorliegt:  
1mol alpha-Cyclodextrin : 1mol einer essentiellen Fettsäure  
15 2mol alpha-Cyclodextrin : 1mol einer essentiellen Fettsäure  
3mol alpha-Cyclodextrin : 1mol einer essentiellen Fettsäure  
4mol alpha-Cyclodextrin : 1mol einer essentiellen Fettsäure  
  
1mol beta-Cyclodextrin : 1mol einer essentiellen Fettsäure  
20 2mol beta-Cyclodextrin : 1mol einer essentiellen Fettsäure  
3mol beta-Cyclodextrin : 1mol einer essentiellen Fettsäure  
  
1mol gamma-Cyclodextrin : 1mol einer essentiellen Fettsäure  
2mol gamma-Cyclodextrin : 1mol einer essentiellen Fettsäure  
3mol gamma-Cyclodextrin : 1mol einer essentiellen Fettsäure  
  
oder eine Mischung dieser Komplexe.
4. Komplex aus Cyclodextrin und einer essentiellen Fettsäure  
30 im molaren Verhältnis 3 : 1 oder 4 : 1.
5. Komplex nach Anspruch 4, dadurch gekennzeichnet, dass es sich bei dem Cyclodextrin um alpha-Cyclodextrin handelt.
- 35 6. Mischung aus Cyclodextrin und einer essentiellen Fettsäure enthaltend einen Komplex gemäß Anspruch 4 oder 5.

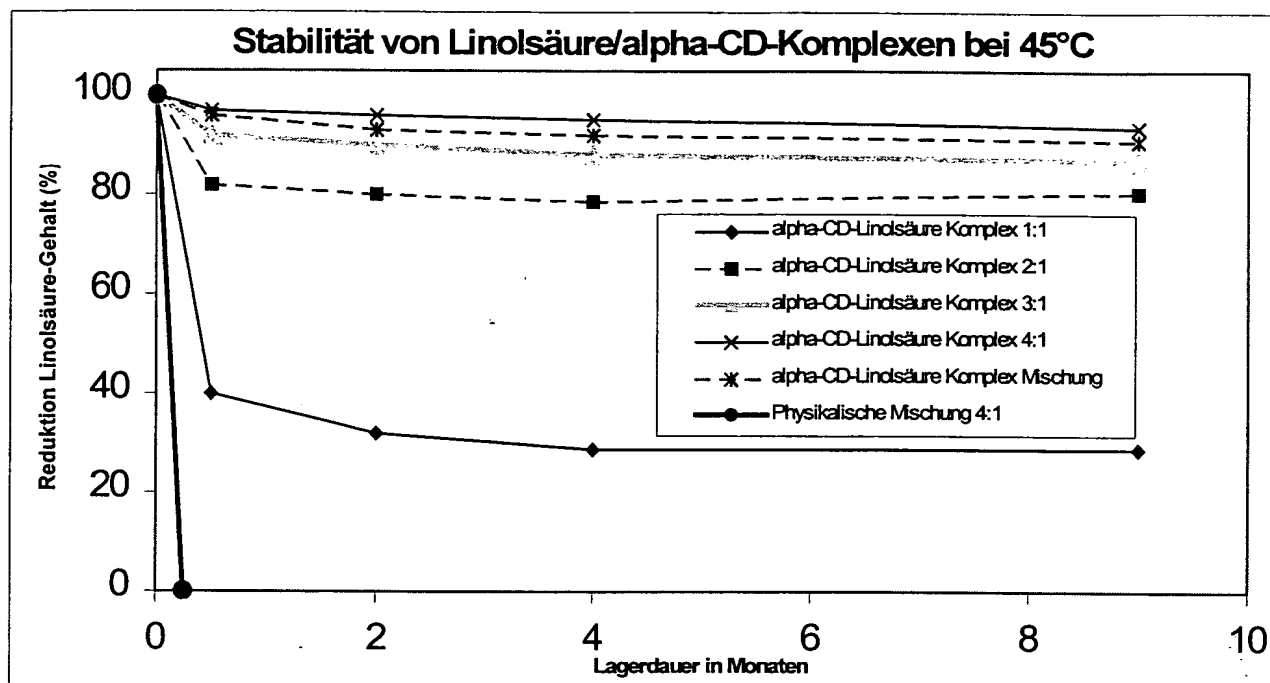
7. Mischung gemäß Anspruch 6, dadurch gekennzeichnet, dass sie einen 4:1 Komplex von alpha CD und essentieller Fettsäure in einer Menge von 10 bis 90 Gew. %, oder einen 3:1 Komplex von alpha CD und essentieller Fettsäure in einer Menge von 40 bis 80 Gew. %, oder einen 2:1 Komplex von alpha CD und essentieller Fettsäure in einer Menge von 30 bis 70 Gew. %, oder einen 1:1 Komplex von alpha CD und essentieller Fettsäure in einer Menge von 20 bis 60 Gew. % enthält.

8. Zubereitung gemäß Anspruch 1, 2 oder 3, dadurch gekennzeichnet, dass sie ferner eine oder mehrere der folgenden Komponenten enthält: lineare wie cyclische Silikonöle, feuchthaltende Mittel, Substanzen, welche die Haut pflegen, Gel-Bildner, O/W oder W/O-Emulgatoren, Konservierungsmittel, Bakterizide, Antioxidantien, Sonnenschutzfilter, anorganische Pigmente, Selbstbräunungsmittel, Zusatzstoffe- und Hilfsstoffe, Konsistenzgeber, Füllstoffe, Elektrolyte, Vitamine, Alkohol, Wasser, Salze, Stabilisatoren, Farbstoffe, Parfüme, etherische Öle.

9. Verfahren zur Herstellung einer Zubereitung gemäß Anspruch 1, 2, 3 oder 8, dadurch gekennzeichnet, dass ein Komplex aus Vitamin F und Cyclodextrin in Wasser dispergiert wird und anschließend in den lipophilen Teil der Emulsion eingemischt wird.

10. Verfahren gemäß Anspruch 9, dadurch gekennzeichnet, dass die Dispergierung über einen Zeitraum von 10 Minuten bis 2 Stunden bei Temperatur von 20°C bis 80°C erfolgt.

Fig. 1:



### **Zusammenfassung**

#### **Kosmetische Zubereitung enthaltend einen Komplex aus Cyclo- dextrin und Vitamin F**

5

Kosmetische oder dermatologische Zubereitungen enthaltend Vitamin F, dadurch gekennzeichnet, dass das Vitamin F in Form eines Komplexes mit einem Cyclodextrin ausgewählt aus der Gruppe alpha, beta- und gamma- Cyclodextrin vorliegt.